



**Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets**



(11) Veröffentlichungsnummer: **0 354 418 A3**

12

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 89113917.2

⑤) Int. Cl.<sup>5</sup>: **C07D 405/06**, C07D 407/06,  
C07D 409/06, C07D 207/337,  
C07D 213/48, C07D 213/55,  
C07D 237/08, C07D 239/26,  
C07D 307/54, C07D 309/30,  
C07D 333/24, //C07D207/333,  
C07D333/22,C07D307/46,  
A61K31/365

(22) Anmeldetag: 28.07.89

③ Priorität: 06.08.88 DE 3826814

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
**14.02.90 Patentblatt 90/07**

⑧ Benannte Vertragsstaaten:  
**AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI LU NL SE**

88 Veröffentlichungstag des später veröffentlichten Recherchenberichts: 31.07.91 Patentblatt 91/31

(71) Anmelder: HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT  
Postfach 80 03 20  
W-6230 Frankfurt am Main 80(DE)

72) Erfinder: **Beck, Gerhard, Dr.**  
**Gustav-Freytag-Strasse 24**  
**W-6000 Frankfurt am Main(DE)**

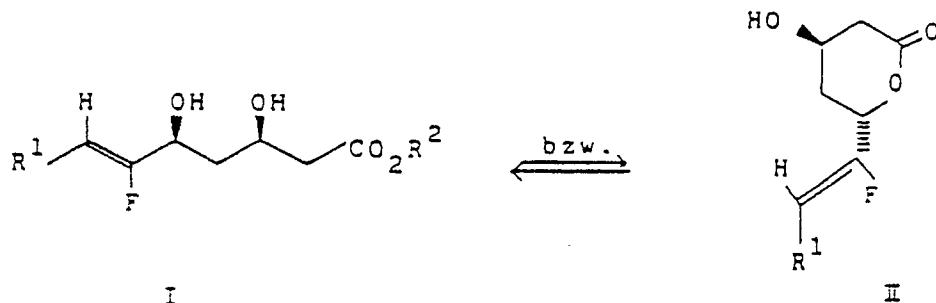
Erfinder: **Bartmann, Wilhelm, Prof. Dr.**  
**Am Dachsbau 5**  
**W-6232 Bad Soden am Taunus(DE)**

Erfinder: **Wess, Günther, Dr.**  
**Langenselboldweg 35**  
**W-6455 Erlensee(DE)**

Erfinder: **Granzer, Ernold, Dr. Dr.**  
**Falkensteiner Strasse 24**  
**W-6233 Kelkheim (Taunus)(DE)**

**54) Neue 6-Fluor-3,5-dihydroxycarbonsäuren und deren Derivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, ihre Verwendung als Arzneimittel, pharmazeutische Präparate und Zwischenprodukte.**

**(57) 6-Fluor-3,5-dihydroxycarbonsäurederivate der Formel I bzw. die entsprechenden Laktone der Formel II**



EP 0354418 A3

worin R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die angegebenen Bedeutungen haben, Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, ihre Verwendung als Arzneimittel und pharmazeutische Präparate werden beschrieben. Außerdem werden neue Zwischenprodukte für die Herstellung der Verbindungen der Formel I bzw. Formel II beschrieben.



Europäisches  
Patentamt

**EUROPÄISCHER TEILRECHERCHENBERICHT,**  
der nach Regel 45 des Europäischen Patent-  
Übereinkommens für das weitere Verfahren als  
europäischer Recherchenbericht gilt

Nummer der Anmeldung  
EP 89113917  
– Seite 1 –

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betritt Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl.)
A, P	EP-A-0306929 (WARNER-LAMBERT CO.) * Seiten 7,8; Ansprüche 1,2,4,9,11 *	1-3,5, 7-9	C07D405/06 C07D407/06 C07D409/06
A, D, P	DE-A-3800785 (HOECHST AG) * Ansprüche 1,5,6,8-10. *	1-3,5, 7,8	C07D207/337 C07D213/48 C07D213/55 C07D237/08
A, D, P	DE-A-3722807 (HOECHST AG) * Ansprüche 1,5,6,8-10 *	1-3,5, 7,8	C07D239/26 C07D307/54 C07D309/30
A, D, P	DE-A-3722806 (HOECHST AG) * Ansprüche 1,4,9-12,14 *	1-3,5, 7,8	C07D333/24 //C07D207/333 C07D333/22 C07D307/46
A	US-A-4681893 (B.D. ROTH) * Spalte 2, Zeile 3 - Spalte 3, Zeile 28 *	1-3,5,7 ...	A61K31/365
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl.)
			C07D207/00 C07D213/00 C07D237/00 C07D239/00 C07D309/00 C07D405/00 C07D407/00 C07D409/00 C07C33/00 C07C45/00 C07C47/00 C07C69/00
UNVOLLSTÄNDIGE RECHERCHE			
<p>Nach Auffassung der Recherchenabteilung entspricht die vorliegende europäische Patentanmeldung den Vorschriften des Europäischen Patentübereinkommens so wenig, daß es nicht möglich ist, auf der Grundlage einiger Patentansprüche sinnvolle Ermittlungen über den Stand der Technik durchzuführen.</p> <p>Vollständig recherchierte Patentansprüche: 1-3,5-9      Unvollständig recherchierte Patentansprüche: -      Nicht recherchierte Patentansprüche: 4      Grund für die Beschränkung der Recherche:</p> <p style="text-align: center;">Artikel 52(4) EPÜ</p>			
Recherchenort	Abschlußdatum der Recherche	Prüfer	
Berlin	23.04.1991	C. HASS	
<b>KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN</b> X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : nichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze		E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmelde datum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument  & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument	



EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.)
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	betrifft Anspruch	
A	JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY Band 28, Nr. 3, 1985, Seiten 347-358; G.E. STOKKER et al.: "3-Hydroxy-3-methylglutaryl-coenzyme A Reductase Inhibitors. I. Structural Modification of 5-Substituted 3,5-Dihydroxypentanoic Acids and Their Lactone Derivatives" * Seite 352, Schema I *	1,2,5,7	
A,D	EP-A-0221025 (SANDOZ AG) * Ansprüche 1-3,7,10 *	1-3	
A,P	DE-A-3722809 (HOECHST AG) * Ansprüche 1,5 *	1,3	RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.)
A,D	JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY Band 29, Nr. 2, 1986, Seiten 170-181; G.E. STOKKER et al.: "3-Hydroxy-3-methylglutaryl-coenzyme A Reductase Inhibitors. 3. 7-(3,5-Disubstituted (1,1'-biphenyl)-2-yl)-3,5-dihydroxy-6-heptenoic Acids and Their Lactone Derivatives * das ganze Dokument *	1,2	
A	TETRAHEDRON Band 40, Nr. 15, 1984, Seiten 2871-2878, US; F. CAMPS et al.: "Synthesis of dienic fluorinated analogs of insect sex pheromones" * Seite 2872, Verbindungen 8a-d *	5	
A	TETRAHEDRON Band 35, 1979, Seiten 2645-2653, GB; C. CHUIT et al.: "Réaction du diméthylcuprate de lithium avec les dérivés carbonylés alpha,beta-insaturés alpha-fluorés et alpha-chlorés" * Seite 2647, Verbindungen 10,12 *	8,9	
		...	



Europäisches  
Patentamt

# EUROPÄISCHER TEILRECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung

EP 89113917

- Seite 3 -

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.CI.)
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	betrifft Anspruch	
A	CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN Band 35, Nr. 4, 1987, Seiten 1666-1669, T. TAGUCHI et al.: "Synthesis of 5-fluoroarachidonic acid and its biotransformation to 5-fluoro-12-hydroxyeicosatetraenoic acid" * Seite 1668, Verbindung 5 *	8	
			RECHERCHIERTE SACHGEBiete (Int.CI.)